(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

- (19) Weltorganisation für geistiges Eigentum Internationales Büro
- AIPO OMPI



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum 16. Oktober 2003 (16.10.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer WO 03/084533 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: A61K 31/402, 31/451, C07D 207/22, 211/72, 401/12, 453/06

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP03/02349

(22) Internationales Anmeldedatum:

7. März 2003 (07.03.2003)

(25) Einreichungssprache:

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

Deutsch

(30) Angaben zur Priorität: 102 14 832.5 4. April 2002 (04.04.2002) E

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): MERCK PATENT GMBH [DE/DE]; Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): CEZANNE, Bertram [DE/DE]; Bahnstrasse 74, 64546 Mörfelden-Walldorf (DE). DORSCH, Dieter [DE/DE]; Königsberger Strasse 17A, 64372 Ober-Ramstadt (DE). MEDERSKI, Werner [DE/DE]; Katzenelnbogenweg 1, 64673 Zwingenberg (DE). TSAKLAKIDIS, Christos [GR/DE]; Im Langgewann 54, 69469 Weinheim (DE). BARNES, Christopher [GB/DE]; Alleestrasse 1, 65812 Bad Soden (DE).

GLEITZ, Johannes [DE/DE]; Liebigstrasse 26, 64293 Darmstadt (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: MERCK PATENT GMBH; Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: N-'4-(2-IMINO-PYRROLIDIN-1-YL)PHENYL!-ACETAMIDE AND CORRESPONDING PIPERIDING DERIVATIVES AS FACTOR XA INFIBITORS FOR THE TREATMENT OF THROMBO-EMBOLIC DISEASES

(54) Bezeichnung: N-'4-(2-IMINO-PYRROLIDIN-1-YL)PHENYL!-ACETEMID-UND ENTSPRECHENDE PIPERIDINDERI-VATE ALS FAKTOR XA INHIBITOREN ZUR BEHANDLUNG VON THROMBOEMBOLISCHEN ERKRANKUNGEN

(57) Abstract: The invention relates to novel compounds of formula (I) wherein D, M, W, X, Y, T and R¹ have the designation cited in patent claim 1. According to the invention, said compounds are inhibitors of the coagulation factor Xa and can be used for the prophylaxis and/or treatment of thromboembolic diseases and for the treatment of tumours.

(57) Zusammenfassung: Neue Verbindungen der Formel (I), worin D, M, W, X, Y, T und R¹ die in Patentanspruch 1 angegebene Bedeutung haben, sind Inhibitoren des Koagulationsfaktors Xa und können zur Prophylaxe und/oder Therapie von thromboembolischen Erkrankungen und zur Behandlung von Tu-

O 03/084533 A

moren eingesetzt werden.

Abstract

Novel compounds of the formula I

5

$$H_2N$$
 R
 $(CH_2)_n$
 VI

10

in which

D, M, W, X, Y, T and R¹ are as defined in Patent Claim 1,

15

are inhibitors of coagulation factor Xa and can be employed for the prophylaxis and/or therapy of thromboembolic diseases and for the treatment of tumours.

20

25

30

35